

This Page Is Inserted by IFW Operations  
and is not a part of the Official Record

## **BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning documents *will not* correct images,  
please do not report the images to the  
Problem Image Mailbox.**

特許法第38条ただし書  
の規定による特許出願

特許庁長官 片山石郎 殿

- 電話 585-2256 (02-550-1028)



～ 4 冊の丁ルである。

- \*c1ccc(cc1)C(=O)c2c(O)cnc2-c3ccc(\*)cc3

7.  $R_0$  がメタルである際の知許感度の範囲外

461K 31/44

1～6項記載のいずれかによる化合物。

8.  $R_1$ ,  $R_2$  が水素、フッ素、塩素、トリフルオルメチル、メチルまたはメトキシである際の特許請求の範囲第1～7項記載のいずれかによる化合物。

9.  $R_1$  が水素、塩素、トリフルオルメチル、メチルまたはメトキシである際の特許請求の範囲第8項記載の化合物。

10.  $R_1$ ,  $R_2$  及び  $R_3$  がそれぞれ水素であり、そして  $R_4$  がメチルである際の特許請求の範囲第1項記載の式1の化合物。

11.  $R_1$  及び  $R_2$  がそれぞれ水素であり、 $R_3$  がメチルであり、そして  $R_4$  が  $p$ -クロルである際の特許請求の範囲第1項記載の式1の化合物。

12.  $R_1$  及び  $R_2$  がそれぞれ水素であり、 $R_3$  がメチルであり、そして  $R_4$  が  $p$ -フルオルである

メチルであり、そして  $R_4$  が  $p$ -フルオルである際の特許請求の範囲第1項記載の式1の化合物。

13.  $R_1$  及び  $R_2$  がそれぞれ水素であり、 $R_3$  がメチルであり、そして  $R_4$  が  $o$ -メチルである際の特許請求の範囲第1項記載の式1の化合物。

14.  $R_1$  及び  $R_2$  がそれぞれ水素であり、 $R_3$  がメチルであり、そして  $R_4$  が  $m$ -メトキシである際の特許請求の範囲第1項記載の式1の化合物。

20.  $R_1$  及び  $R_2$  がそれぞれ水素であり、 $R_3$  がメチルであり、そして  $R_4$  が  $m$ -トリフルオルメチルである際の特許請求の範囲第1項記載の式1の化合物。

21.  $R_1$  及び  $R_2$  がそれぞれ水素であり、 $R_3$  がメチルであり、そして  $R_4$  が  $o$ -メチルである際の特許請求の範囲第1項記載の式1の化合物。

特開51-113877 (2)

項の特許請求の範囲第1項記載の式1の化合物。

13.  $R_1$  及び  $R_2$  がそれぞれ水素であり、 $R_3$  がメチルであり、そして  $R_4$  が  $o$ -メチルである際の特許請求の範囲第1項記載の式1の化合物。

14.  $R_1$  及び  $R_2$  がそれぞれ水素であり、 $R_3$  がメチルであり、そして  $R_4$  が  $p$ -メトキシである際の特許請求の範囲第1項記載の式1の化合物。

15.  $R_1$  及び  $R_2$  がそれぞれ水素であり、 $R_3$  がメチルであり、そして  $R_4$  が  $m$ -トリフルオルメチルである際の特許請求の範囲第1項記載の式1の化合物。

16.  $R_1$  及び  $R_2$  がそれぞれ水素であり、 $R_3$  がメチルであり、そして  $R_4$  が  $p$ -クロルである際の特許請求の範囲第1項記載の式1の化合物。

17.  $R_1$  及び  $R_2$  がそれぞれ水素であり、 $R_3$  が

22.  $R_1$  が水素であり、 $R_2$  がメチルであり、 $R_3$  が  $p$ -クロルであり、そして  $R_4$  が  $p$ -クロルである際の特許請求の範囲第1項記載の式1の化合物。

23.  $R_1$  が  $p$ -クロルであり、 $R_2$  が水素であり、 $R_3$  がメチルであり、そして  $R_4$  が  $p$ -クロルである際の特許請求の範囲第1項記載の式1の化合物。

24. 遊離ヒドロキシ型における特許請求の範囲第1～28項記載のいずれかによる化合物。

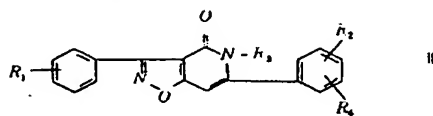
25. 塩化付加型の型における特許請求の範囲第1～28項記載のいずれかによる化合物。

26. アルカリまたはアルカリ土金属塩の型における特許請求の範囲第25項記載の化合物。

27. 遊離ヒドロキシ型または塩型上特許し得

る塩基付加物の形成において溶解媒の組成は 1 ~ 2.8 部重量のいずれかである化合物を溶解し溶解し得る溶解媒を、組成上の割合物として溶んでなる化合物組成物。

# 2.8. 式 II.



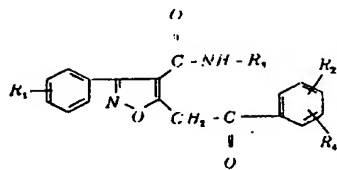
式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、及び  $R_3$  は同一もしくは互に異なるものであることができ、各々水素、フッ素、塩素、トリフルオロメチルまたは炭素原子 1 ~ 4 個のアルキルもしくはアルコキシを兼ね、そして  $R_4$  は炭素原子 1 ~ 4 個のアルキルである。

の化合物を不活性有機媒中で還元することを特

コキシを兼ね、そして  $R_4$  は炭素原子 1 ~ 4 個のアルキルである。

で表わされる化合物。

# 3.0. 式 2.



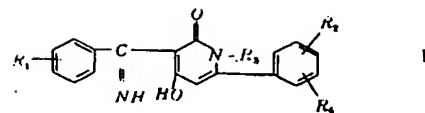
式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、及び  $R_4$  は同一もしくは互に異なるものであることができ、各々水素、フッ素、塩素、トリフルオロメチルまたは炭素原子 1 ~ 4 個のアルキルもしくはアルコキシを兼ね、そして  $R_4$  は炭素原子 1 ~ 4 個のアルキルである。

の化合物を溶解し得る組成下の割合物として溶んでなる化合物組成物の組成は 2.8 部重量のいずれかである化合物を溶解し溶解し得る溶解媒を、組成上の割合物として溶んでなる化合物組成物。

# 3.1. 式 III.

特開昭51-113877 (3)

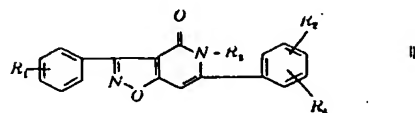
即とする式 I.



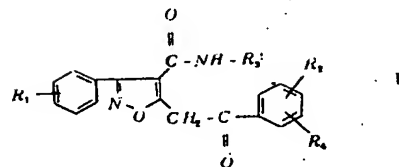
式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、及び  $R_4$  は同一もしくは互に異なるものである。

の化合物の製造方法。

# 2.9. 式 II.



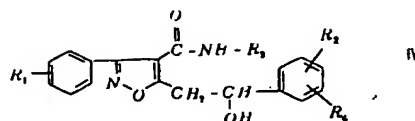
式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、及び  $R_3$  は同一もしくは互に異なるものであることができ、各々水素、フッ素、塩素、トリフルオロメチルまたは炭素原子 1 ~ 4 個のアルキルもしくはアル



式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、及び  $R_3$  は同一もしくは互に異なるものであることができ、各々水素、フッ素、塩素、トリフルオロメチルまたは炭素原子 1 ~ 4 個のアルキルもしくはアルコキシを兼ね、そして  $R_4$  は炭素原子 1 ~ 4 個のアルキルである。

で表わされる化合物。

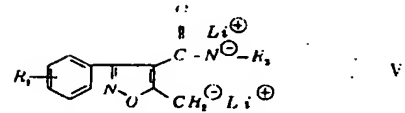
# 3.2. 式 II.



〜4個のアルキルである、

で表わされる化合物。

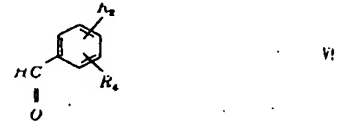
#### 8.4. 式V.



式中、 $R_1$ 、及び $R_2$ は特許請求の範囲第

8.8項に示した追加のものである、

の化合物を不活性有機酸塩中にて式V、



式中、 $R_2$ 、及び $R_3$ は特許請求の範囲第

8.8項に示した追加のものである、

の化合物と反応させることからなる特許請求の範囲

式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、及び $R_4$ は特許請求

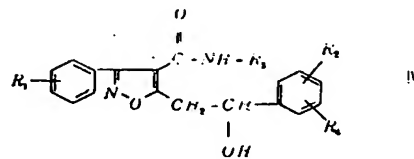
の範囲第8.1項に示した追加のものである、

る、

の化合物を塩化するとからなる特許請求の範囲

第8.1項に示した追加のものである、

#### 8.3. 式II.



式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、及び $R_3$ は同一もしくは互

に異なるものであることができ、各々水素、

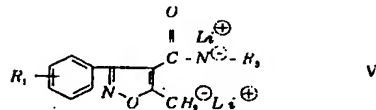
フッ素、塩素、トリフルオロメチルまたは

炭素原子1〜4個のアルキルもしくはアル

コキシを被置き、そして $R_4$ は炭素原子1

開第8.8項に示した追加のものである、

#### 8.5. 式V.



式中、 $R_1$ は水素、フッ素、塩素、トリフ

ルオロメチルまたは炭素原子1〜4個のアル

キルもしくはアルコキシを被置き、そして

て $R_2$ は炭素原子1〜4個のアルキルであ

る、

で表わされる化合物。

#### 8.6. 相應する8-フェニル-N'-アルキル-

5-メチルインキサゾロ-4-カルボキシアミド

を不活性有機酸塩中にて $C_{1-4}$ アルキルリチウム

と反応させることからなる特許請求の範囲第8.5

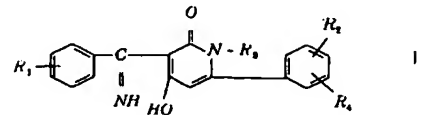
項に示した追加のものである、

#### 8.7. 式Vの特許請求の範囲

本発明は8-( $\alpha$ -イミノベンジル)-4-ヒ

ドロキシ-2(1H)-ピリドン誘導体に関する、

開第8.8項に示した追加のものである、



式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、及び $R_3$ は同一もしくは互

に異なるものであることができ、各々水素、

フッ素、塩素、トリフルオロメチルまたは

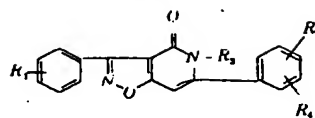
炭素原子1〜4個のアルキルもしくはアル

コキシを被置き、そして $R_4$ は炭素原子1

〜4個のアルキルである、

の化合物を提供する。

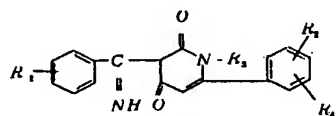
また本発明式Ⅱ、



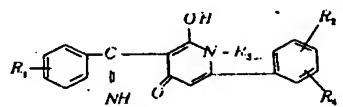
式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、及び $R_4$ は上記定義した如きものである、

の化合物を不活性な溶剤中にて還元することからなる式Ⅰの化合物の製造方法を提議する。

本方法は精造の方法において、例えば銅が還元剤添加によつて行なうことができる。無活性溶剤には炭素酸塩持たせたパラジウム、酸化白金及びラネーニッケルが用いられ、好ましくは炭素酸塩持たせたパラジウムである。不活性溶剤の例は例えばアルカノール、例えばメタノール、または好ましくはエタノールが常用に用いられる。本要約



1b



1c

式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、及び $R_4$ は上記定義した如きものである、

の互変異性体として併用される。

上記及び本発明においては本式Ⅰの如き又は対応する化学名のみを示したか、不活性な化合物の特定の例に、或いは特定の又は用途に限定する意味のないことを理解すべきである。

式Ⅱの化合物は式Ⅲ、

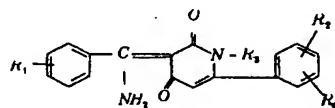
特開第51-113877(5)

加熱10°~50℃、好ましくは20°~80℃

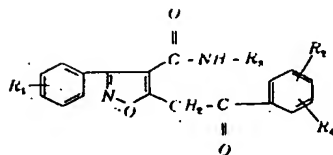
の範囲で有利に行なわれ、反応時間は例えば1~10時間、中間断片は2~8時間の範囲であるとかである。

生じた式Ⅰの化合物は精造の方法を用いて単離し、そして提煉することができる。必要に応じて該化合物の高純ヒドロキシ基を精造の方法で炭素酸塩持たせることができ、そしてまたその逆も可能である。

から分かる如く、式Ⅰの化合物は式1a、1b及び1c、



1a



1b

式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、及び $R_4$ は上記定義した如きものである、

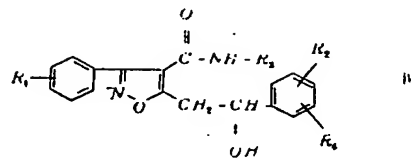
の化合物を所定の溶剤の存在下において単離し、そして提煉することができる。

この式Ⅰ化合物の方法において、例えば式Ⅲの化合物を、例えば炭素酸塩、カーボンエンズ、ホリン酸または好ましくは炭素酸塩、且つ炭素酸塩不活性な炭素酸塩持たせた水、例えばベンゼンまたはトルエン中で処理して行なうことができる。しかしながら、好ましくは炭素酸塩を用いて、炭素酸塩提煉することができる。

の方法は 80° ～ 150℃、好ましくは反応が全物の過半数まで進行するまで、反応時間は例えば 12 ～ 86 時間、但し必要は 20 ～ 86 時間の範囲であることができる。

生じた式 II の化合物は、精造の方法を用いて中和し、そして精製することができる。

式 II の化合物は式 IV



式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、及び  $R_5$  は上記で

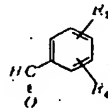
説明した如きものである。

の化合物を用いて中和することができる。

この中和は精造の方法において、例えば過マン

のである。

の化合物を不溶は有機酸塩として式 VI



の化合物として示されておけることができる。

上記の反応は温度は 75° ～ 95° で、好ましくは 85° ～ 90° の範囲で行なわれ、溶媒が水、有機酸塩化合物、例えばペンタン、ヘキサン及びヘプタン並びに好ましくはエーテル、例えばジエチルエーテルまたは酢酸テトラヒドロフランが含まれる。反応時間は例えば 1 ～ 5 時間、好く 2.5 ～ 3.5 時間の範囲であることができる。式 V の化合物は精造の方法において、例えば 3-フェニル-N-アルキル-5-ノチル-イソキサ

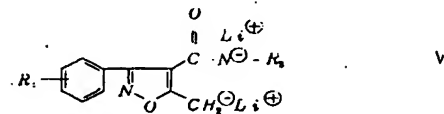
特開第 51-113877 (6)

ガンマカリウムまたは好ましくは三セジウムにより、水溶液条件下で行なうことができる。

化合物は過剰の例えば過剰な塩基に及び好ましくは、有機酸、好く硝酸が含まれる。反応温度は好く 10° ～ 50℃、好ましくは 20° ～ 30℃ であり、反応時間は例えば 1 ～ 5 時間、但し必要は 1.5 ～ 2.5 時間の範囲であることができる。

生じた式 III の化合物は精造の方法を用いて中和し、そして精製することができる。

式 III の化合物は式 V



式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、及び  $R_5$  は上記で説明した如きものである。

ゾール-4-カルボキシアミドから、例えば化合物を存在する溶液の次の段階の条件下で例えば、 $R_1$ 、アルキルリチウム、例えば n-ブチルリチウムとの反応によってその場で生成することが望ましい。

生じた式 III の化合物は精造の方法を用いて中和し、そして精製することができる。

式 III の化合物及び式 V の化合物を生成する反応に必要な塩基は公知のものであるが、あるいは入換する物質から精造の方法で知られることができる。

式 I の化合物は薬理学的活性を有する。好くは化合物は次の薬理活性によって示される痛く睡眠誘発及び二次的なトランキライザー活性を有する：

1) ウィンター (Winter), J. Pharmacol.





6. 添付書類の目録

1. 明 細 書	1 通
<del>特 許 証 書</del>	<del>1 通</del>
2. 委任状及びその訳文	各 1 通
<del>特許証書及びその訳文</del>	<del>各 1 通</del>
<del>特許証書及びその訳文</del>	<del>各 1 通</del>
3. 発明者証明書及びその訳文	各 2 通

7. 前記以外の発明者、特許出願人または代理人

(1) 発 明 者

姓 名

氏 名

住 所

正 任